

证 明

本证明之附件是向本局提交的下列专利申请副本

REC'D 01 DEC 2004	
WIPO	PCT

申 请 日： 2003. 09. 26

申 请 号： 03146951.5

申 请 类 别： 发明

发明创造名称： 复方青蒿素

申 请 人： 李国桥

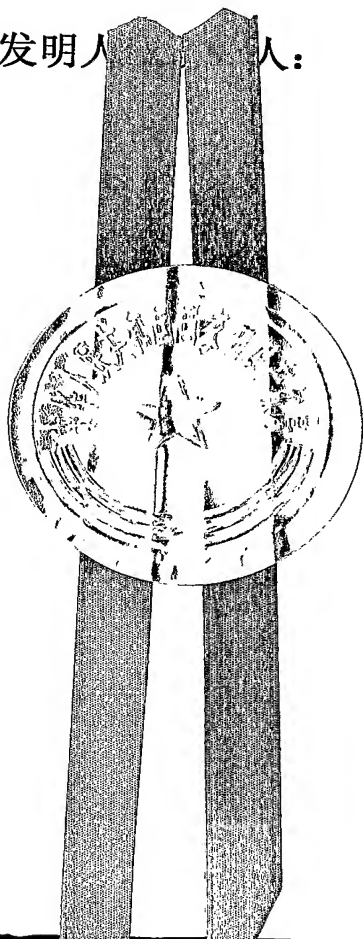
发明人： 李国桥、宋建平

**PRIORITY
DOCUMENT**
SUBMITTED OR TRANSMITTED IN
COMPLIANCE WITH RULE 17.1(a) OR (b)

中华人民共和国
国家知识产权局局长

王景川

2004 年 10 月 22 日



1. 一种复方青蒿素，其特征在于用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉，复方包括以下成份：青蒿素（Artemisinin）、哌喹（Piperaquine）、伯氨喹（Primaquine），三药的配伍比例范围是：

青蒿素（Artemisinin）	1 份
哌喹（Piperaquine）	3—9 份
伯氨喹（Primaquine）	0—0.2 份

三药的最佳配比是 1: 6: 0.6。

2. 根据权利要求 1 所述的复方青蒿素，其特征在于所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。

复方青蒿素

所属技术领域

本发明涉及治疗疟疾的药物，特别是具有高效速效疗效的复方青蒿素。

背景技术

现有技术中的治疟药物有的采用青蒿素衍生物（如双氢青蒿素、青蒿琥酯、蒿甲醚、蒿乙醚）与长半衰期的哌喹配伍，使得疗程长，容易使疟原虫产生抗药性；有的用哌喹和伯氨喹的磷酸盐，由于其磷酸盐对胃肠道有副作用，故疗效欠佳。现有技术的治疟药物还存在生产工艺长，成本高，药物稳定保质期短，服用量大等缺点。

发明内容

本发明的目的旨在克服现有技术的不足而提供一种具有疗程短，副作用更小，原料成本更低、服用更方便、有高效速效的复方青蒿素。

本发明的目的是这样实现的：

一种复方青蒿素，用该复方可制成片剂、儿童颗粒剂、栓剂、混悬糖浆或干粉，复方包括以下成份：青蒿素（Artemisinin）、哌喹（Piperaquine）、伯氨喹（Primaquine），三药的配伍比例范围是：

青蒿素（Artemisinin）	1 份
哌喹（Piperaquine）	3—9 份
伯氨喹（Primaquine）	0—0.2 份

三药的最佳配比是 1：6：0.6。

——所述的伯氨喹还可单独制成片剂与青蒿素+哌喹的混合片剂同时服用。

本发明通 600 多例临床试验，对多重抗药性恶性疟、间日疟和三日疟证明本药具有速效、高效、低毒、短疗程、快速清除传染源以阻断疟疾传播的特点，其疗效、功能明显优于目前国内外的同类药。

具体实施方式

按下述配方取量：

青蒿素（Artemisinin）	120g
哌喹（Piperaquine）	1200g
伯氨喹（Primaquine）	6g
辅料（羟丙基纤维素等）	适量
制成	1000 片

制剂工艺：

将合格的原料分别粉碎，过 100 目筛，然后按处方量准确取原料及辅料，将各组分混合均匀压片或作成各种儿童剂型，包装即成为成品。

本发明复方青蒿素用于治疗各类疟疾（恶性疟、间日疟、三日疟等人类疟疾），尤其是多重抗药性恶性疟，成人总剂量为 2 片，每天服 1 片。

本复方中的伯氨喹含量每片仅含 6mg，即一天用量，仅用 2 天，此剂量是比常规用量 3 天 67.5mg 减少了 82%，与青蒿素配合应用，经实验研究证明可使恶性疟原虫配子体在首剂服药后 24 小时即完全失去感染性，从而阻断其传播，又无任何副作用。这是该复方使用超低剂量伯氨喹的一大特点。

由于本复方比任何青蒿素类复方的主要原料的成本更低，体积更小，疗程更短，服用更方便（成人 2 天 2 片），且具有明显杀灭配子体阻断疟疾传播的作用，因而有利于该复方以较低的价格进入发展中国家公立医院，更有利于全球抗疟措施的推广应用。